


VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055200	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEAA16	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/014392	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 17.12.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 19.12.2003
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07C237/42 C07C271/10 C07C271/26 C07C275/24 C07C275/28 C07C309/66 C07C311/06 C07C323/60 C07C327/34 C07C333/04 C07C333/08 A01N37/18		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 7 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 7 Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Berichts</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 03.12.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 27.03.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Österle, C Tel. +49 89 2399-8120	



INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/014392

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
 - ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

Beschreibung, Seiten

1-108 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-12 eingegangen am 03.12.2005 mit Schreiben vom 01.12.2005

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
 - ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
 - ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

1. Folgende Teile der Anmeldung wurden nicht daraufhin geprüft, ob die beanspruchte Erfindung als neu, auf erfinderischer Tätigkeit beruhend (nicht offensichtlich) und gewerblich anwendbar anzusehen ist:

☐ die gesamte internationale Anmeldung,

☒ Ansprüche Nr. 1-4 und 6-12 (Teil)

Begründung:

☐ Die gesamte internationale Anmeldung, bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. beziehen sich auf den nachstehenden Gegenstand, für den keine internationale vorläufige Prüfung durchgeführt werden braucht (*genaue Angaben*):

☐ Die Beschreibung, die Ansprüche oder die Zeichnungen (*machen Sie bitte nachstehend genaue Angaben*) oder die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unklar, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte (*genaue Angaben*):

☐ Die Ansprüche bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unzureichend durch die Beschreibung gestützt, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte.

☒ Für die obengenannten Ansprüche Nr. 1-4 und 6-12 (Teil) wurde kein internationaler Recherchenbericht erstellt.

☐ Das Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenzprotokoll entspricht nicht dem in Anhang C zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen Standard, weil

die schriftliche Form

☐ nicht eingereicht wurde.

☐ nicht dem Standard entspricht.

die computerlesbare Form

☐ nicht eingereicht wurde.

☐ nicht dem Standard entspricht.

☐ Die Tabellen zum Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenzprotokoll, sofern sie nur in computerlesbarer Form vorliegen, entsprechen nicht den in Anhang C-bis zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen technischen Anforderungen.

☐ siehe Beiblatt für weitere Angaben.

Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

1. ☒ Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder:
- ☐ die Ansprüche eingeschränkt.
 - ☒ zusätzliche Gebühren entrichtet.
 - ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
 - ☐ weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.
2. ☐ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.
3. Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3
- ☐ erfüllt ist.
 - ☒ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:
siehe Beiblatt
4. Daher ist der Bericht für die folgenden Teile der internationalen Anmeldung erstellt worden:
- ☐ alle Teile.
 - ☒ die Teile, die sich auf die Ansprüche mit folgenden Nummern beziehen: 1-4 (Teil), 5, 6-12 (Teil) (1. und 3. Erfindung) .

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
- | | |
|--------------------------------|---------------------|
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-12 |
| | Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1-12 |
| | Nein: Ansprüche |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-12 |
| | Nein: Ansprüche: |
2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):
siehe Beiblatt

Zu Punkt III

Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

Siehe unten unter Punkt IV.

Zu Punkt IV

Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

Im Recherchenbericht wurde bereits auf den Mangel an Einheitlichkeit hingewiesen. Da sich der Recherchenbericht nur auf den Gegenstand der Ansprüche 1-12 für $R^9=OR^{16}$ und $R^9=NR^{18}R^{19}$ bezieht ist der Gegenstand dieses vorläufigen Prüfungsberichtes auch darauf beschränkt.

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- D1: WO 03/066576 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; MENGES, MARKUS; PUHL, MICHAEL; RENTZEA, COSTI) 14. August 2003 (2003-08-14)
- D2: DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SOLOSHONOK, VADIM A. ET AL: "Gold(I)-catalyzed asymmetric aldol reactions of fluorinated benzaldehydes with an .alpha.-isocyanoacetamide" XP002329711 gefunden im STN Database accession no. 1994:534014
- D3: DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SOLOSHONOK, VADIM A. ET AL: "Gold(I)-catalyzed asymmetric aldol reaction of methyl isocyanoacetate with fluorinated benzaldehydes" XP002329712 gefunden im STN Database accession no. 1995:11127
- D4: DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; JOMMI, GIANCARLO ET AL: "Asymmetric synthesis of .beta.-hydroxy-.alpha.-amino acids by condensation of aliphatic and aromatic aldehydes with zinc(II) and copper(II) complexes of (1R)-3-hydroxymethylene boman-2-one glycine imines" XP002329713 gefunden im STN Database

accession no. 1995:177010

- D5: DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SOLOSHONOK, VADIM A. ET AL: "Transition Metal/Base-Catalyzed Aldol Reactions of Isocyanoacetic Acid Derivatives with Prochiral Ketones, a Straightforward Approach to Stereochemically Defined .beta.,.beta.-Disubstituted-.beta.-hydroxy - .alpha.-amino Acids.1 Scope and Limitations" XP002329714 gefunden im STN Database accession no. 1997:315104
- D6: US 4,004,008 (Rotta Research Laboratorium), Jan 18 1977

1. Neuheit (Artikel 33(2) PCT):

- 1.1 Die Verbindungen der D1 unterscheiden sich von den Verbindungen der Ansprüche 1 und 8 durch den Substituenten R⁹. R⁹ entspricht dabei den Substituenten R⁶/R⁷ in D1.

Die Verbindungen der Ansprüche 1 und 8 unterscheiden sich von denen der D2 dadurch, daß R⁷ in der Anmeldung keine Methylgruppe sein kann.

Die Verbindungen der Ansprüche 1 und 8 unterscheiden sich von denen der D3-D5 dadurch, daß R¹ in den vorliegenden Ansprüchen kein Wasserstoff sein kann.

Der Gegenstand der Ansprüche 1-5 und 8 ist daher neu.

- 1.2 Da die Verbindungen des Anspruchs 1 neu sind, werden auch die Verfahren zu deren Herstellung gemäß den Ansprüchen 6 und 7 als neu angesehen.
- 1.3 Da die Verbindungen des Anspruchs 1 neu sind, wird auch deren Verwendung und die Mittel, die diese Verbindungen enthalten gemäß den Ansprüchen 9-12 als neu angesehen.

2. Erfinderische Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT):

- 2.1 D1 offenbart benzoylsubstituierte Phenylalanin-Amide mit herbizider Wirkung.

Im Hinblick auf D1 kann das technische Problem darin gesehen werden weitere Verbindungen bereitzustellen, die ebenfalls herbizide Wirkung haben.

Die von der Anmelderin vorgeschlagene Lösung sind die Verbindungen der Formel (I).

Man kann annehmen, daß es für den Fachmann ausgehend von der D1 nicht offensichtlich ist vorauszusehen, daß eine Änderung des Substituenten R⁹ zu Verbindungen führt, die ebenfalls eine herbizide Wirkung besitzen.

Die Anmelderin hat anhand von Vergleichsversuchen gezeigt, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen eine gegenüber den Verbindungen der D1 verbesserte herbizide Wirkung aufweisen.

Der Gegenstand der Ansprüche 1-7 und 9-12 kann daher auch als erfinderisch angesehen werden.

- 2.2 Die Verbindung des Anspruchs 8 ist ein Zwischenprodukt der Synthese der Verbindungen der Formel I des Anspruchs 1. Da diese Verbindungen einen wichtigen strukturellen Beitrag zur Struktur der Verbindungen der Formel I beitragen, können auch diese als erfinderisch angesehen werden.

3. Industrielle Anwendbarkeit (Artikel 33(4) PCT):

Der Gegenstand der Ansprüche 1-12 ist industriell anwendbar.

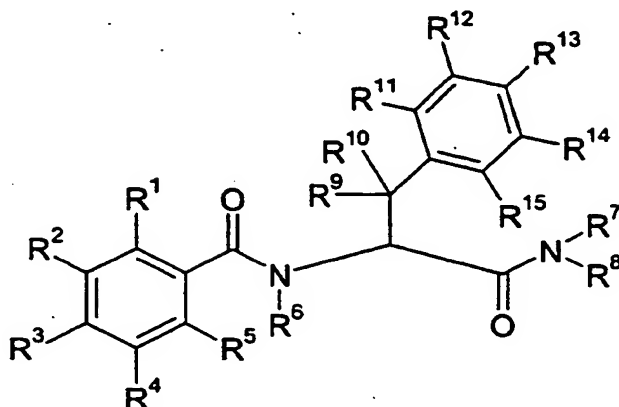
Zu Punkt VIII

Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

1. Der Gegenstand des Anspruchs 7 fällt nicht unter den Gegenstand des Anspruchs 6 und kann daher von diesem nicht abhängig sein. Der Gegenstand des Anspruchs 7 erfüllt daher die Erfordernisse des Artikels 6 PCT nicht.

Patentansprüche:

1. Benzoylsubstituierte Phenylalanin-Amide der Formel I



I,

in der die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

R^1 Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, Nitro, Hydroxycarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio oder Phenyl;

R^2, R^3, R^4, R^5 Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, Nitro, Amino, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, C_1 - C_6 -Alkylthio oder C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl;

R^6, R^7 Wasserstoff, Hydroxy oder C_1 - C_6 -Alkoxy;

R^8 C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Cyanoalkyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkyl;

R^9 OR^{16} , SR^{17} oder $NR^{18}R^{19}$;

R^{10} Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl;

R^{11}, R^{12} Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, Hydroxy, Nitro, Hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, Tri(C_1 - C_6 -alkyl)silyloxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -Alkylthio, (Hydroxycarbonyl)- C_1 - C_6 -alkyl, (C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl)- C_1 - C_6 -alkyl, (Hydroxycarbonyl)- C_2 - C_6 -alkenyl, (C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl)- C_2 - C_6 -alkenyl, (Hydroxycarbonyl)- C_1 - C_4 -alkoxy, (C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl)- C_1 - C_4 -alkoxy, (C_1 - C_4 -Alkylcarbonyl)oxy- C_1 - C_4 -alkyl, Hydroxycarbonyl- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, (C_1 - C_4 -Alkyl-

110

sulfonyl)oxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkyl-O-C(O)-[C₁-C₄-alkyl-O]₃-C₁-C₄-alkyl, Carbamoyloxy-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl)oxy-C₁-C₄-alkyl, [Di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl]oxy-C₁-C₄-alkyl, [(C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl)aminocarbonyl]oxy-C₁-C₄-alkyl, Benzyloxy, wobei der Phenylring durch 1 bis 3 Reste aus der Gruppe Halogen und C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, (C₁-C₄-Alkylsulfonyl)amino, C₁-C₄-(Halogenalkylsulfonyl)amino, (C₁-C₄-Alkylcarbonyl)amino, Carbamoylamino, (C₁-C₄-Alkylamino)carbonylamino, [Di(C₁-C₄-alkyl)amino]-carbonylamino, [(C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl)aminocarbonyl]amino, Phenyl oder Heterocyclyl, wobei der Phenyl- und der Heterocyclylrest der zwei letztgenannten Substituenten ein bis drei Reste aus folgender Gruppe tragen kann: Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, Hydroxycarbonyl und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl;

R¹³, R¹⁴, R¹⁵ Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Nitro, Hydroxy, C₁-C₄-Alkylthio oder Benzyloxy;

R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, Tri(C₁-C₆-alkyl)silyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkynyl, Formyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, C₂-C₆-Alkenylcarbonyl, C₂-C₆-Alkynylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₃-C₆-Alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-Alkynyloxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-Alkynylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonylaminocarbonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-Alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)-aminocarbonyl, Di-(C₁-C₆-alkyl)-aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, N-(C₁-C₆-Alkylamino)-imino-C₁-C₆-alkyl oder N-(Di-C₁-C₆-alkylamino)-imino-C₁-C₆-alkyl,

wobei die genannten Alkyl-, Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, Hydroxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl,

C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy;

5 Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Phenoxycarbonyl, Phenylaminocarbonyl, Phenylsulfonylaminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-(phenyl)-aminocarbonyl, Phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl, Heterocyclyl, Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, Heterocyclylcarbonyl, Heterocyclylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, Heterocyclylloxycarbonyl, Heterocyclylaminocarbonyl, Heterocyclylsulfonylaminocarbonyl, N-(C₁-C₆-Alkyl)-N-(heterocyclyl)-aminocarbonyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,

10 wobei der Phenyl- und der Heterocyclyl-Rest der 17 letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy

15 SO₂R²⁰; -C(O)-[C₁-C₄-alkyl-O]₃-C₁-C₄-Alkyl; oder -C(O)-O-C₁-C₄-Alkyl-O-Phenyl, wobei der Phenylrest gegebenenfalls durch ein bis drei Reste aus der Gruppe Halogen und C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann;

20 R¹⁹ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Halogenalkinyl,

25 wobei die genannten Alkyl- und Cycloalkylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano, Hydroxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Hydroxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy; oder

30 Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, wobei der Phenyl- und der Heterocyclyl-Rest der 4 letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;

40

112

 R^{20} C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl oder Phenyl,

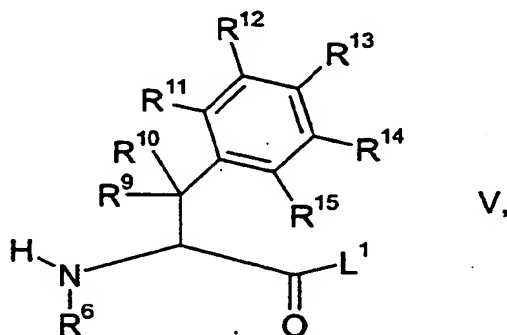
wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogen-alkyl oder C_1-C_6 -Alkoxy;

5

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

2. Benzoylsubstituierte Phenylalanin-Amide der Formel I gemäß Anspruch 1, wobei R^1 für Halogen oder C_1-C_6 -Halogenalkyl steht.
 3. Benzoylsubstituierte Phenylalanin-Amide der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, wobei R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen oder C_1-C_6 -Halogenalkyl stehen.
 4. Benzoylsubstituierte Phenylalanin-Amide der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 3, wobei R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{13} , R^{14} und R^{15} für Wasserstoff stehen.
 5. Benzoylsubstituierte Phenylalanin-Amide der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 4, wobei R^9 für OR^{16} steht.
 6. Verfahren zur Herstellung von benzoylsubstituierten Phenylalanin-Amiden der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet dass
- Phenylalanine der Formel V

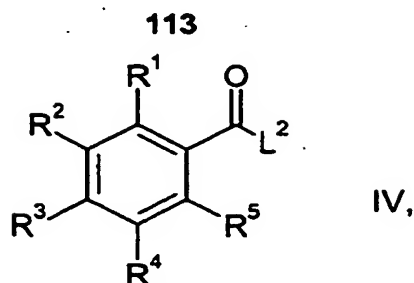
25



30

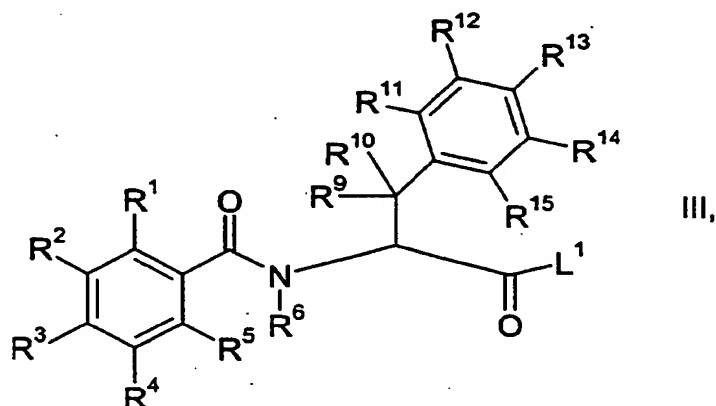
wobei R^6 und R^9 bis R^{15} die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht,

mit Benzoesäuren bzw. Benzoesäurederivaten der Formel IV



wobei R^1 bis R^5 die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L^2 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht,

5 zu entsprechenden Benzoylderivaten der Formel III



wobei R^1 bis R^6 und R^9 bis R^{15} die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht,

10 und anschließend die erhaltenen Benzoylderivaten der Formel III mit einem Amin der Formel II



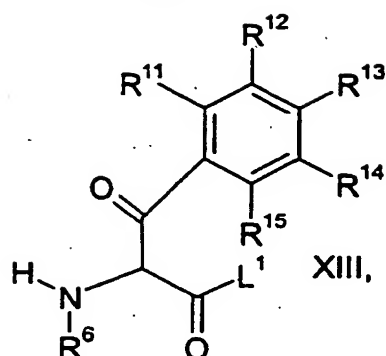
wobei R^7 und R^8 die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben,

15 umgesetzt werden.

7. Verfahren zur Herstellung von benzoylsubstituierten Phenylalanin-Amiden der Formel I gemäß Anspruch 1, wobei R^9 für Hydroxy und R^{10} für Wasserstoff stehen, dadurch gekennzeichnet dass Benzoylderivate der Formel III wobei R^9 für Hydroxy und R^{10} für Wasserstoff stehen, durch Acylierung von Ketoverbindungen der Formel XIII

20

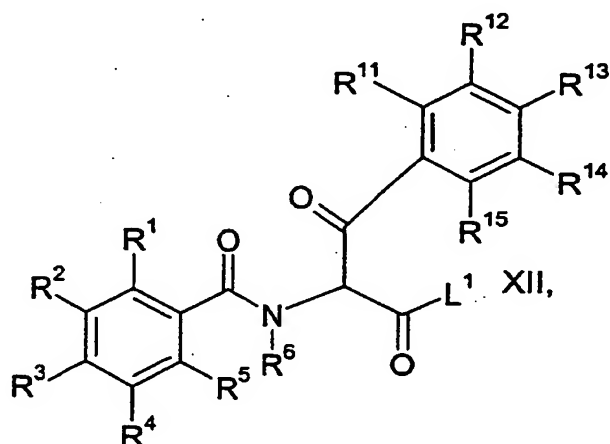
114



wobei R^6 sowie R^{11} bis R^{15} die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht,

5

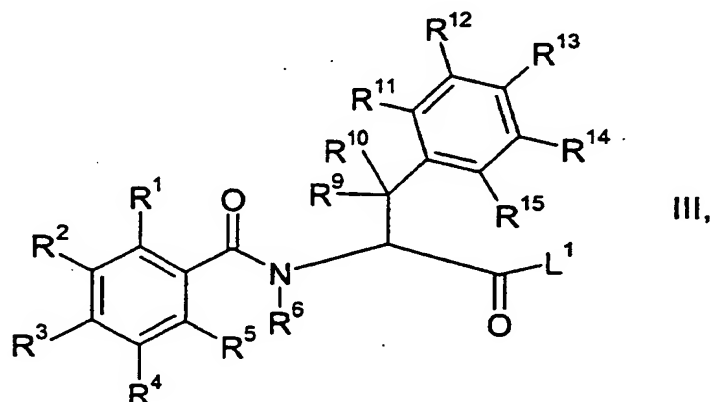
mit Benzoesäure(derivate)n der Formel IV zu N-Acyl-Ketoverbindungen der Formel XII



wobei R^1 bis R^6 sowie R^{11} bis R^{15} die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, und anschließender Reduktion der Ketogruppe hergestellt werden.

10

8. Benzoylderivate der Formel III



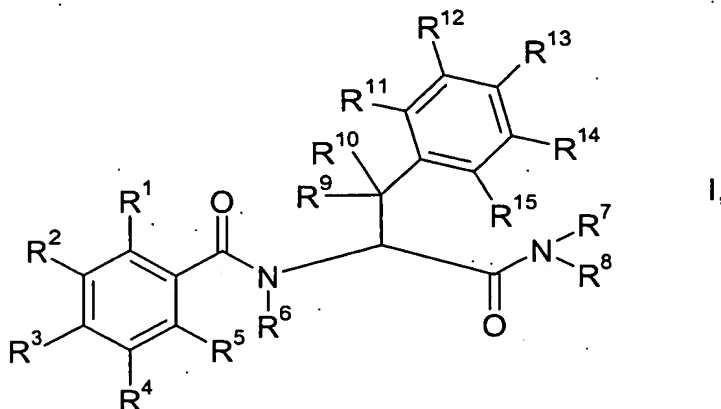
115

wobei R^1 bis R^6 und R^9 bis R^{15} die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L^1 für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht.

- 5 9. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines benzoyl-substituierten Phenylalanin-Amids der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 5 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.
- 10 10. Verfahren zur Herstellung von Mitteln gemäß Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines benzoyl-substituierten Phenylalanin-Amids der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 5 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel mischt.
- 15 11. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines benzoylsubstituierten Phenylalanin-Amids der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 5 auf Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Samen einwirken läßt.
- 20 12. Verwendung der benzoylsubstituierten Phenylalanin-Amide der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 5 und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze als Herbizide.

We claim:

1. A benzoyl-substituted phenylalanineamide of the formula I



5 in which the variables are as defined below:

R^1 is halogen, cyano, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, nitro, hydroxycarbonyl, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -haloalkylthio or phenyl;

10 R^2, R^3, R^4, R^5 are hydrogen, halogen, cyano, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, nitro, amino, C_1 - C_6 -alkylamino, di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, C_1 - C_6 -alkylthio or C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl;

R^6, R^7 are hydrogen, hydroxyl or C_1 - C_6 -alkoxy;

15

R^8 is C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_4 -cyanoalkyl or C_1 - C_6 -haloalkyl;

R^9 is OR^{16} , SR^{17} or $NR^{18}R^{19}$;

20

R^{10} is hydrogen, or C_1 - C_6 -alkyl;

R^{11}, R^{12} are hydrogen, halogen, cyano, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, hydroxyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, hydroxyl, nitro, hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, tri(C_1 - C_6 -alkyl)silyloxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylthio, (hydroxycarbonyl)- C_1 - C_6 -alkyl, (C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl)- C_1 - C_6 -alkyl, (hydroxycarbonyl)- C_2 - C_6 -alkenyl, (C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl)- C_2 - C_6 -alkenyl, (hydroxycarbonyl)- C_1 - C_4 -alkoxy, (C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl)- C_1 - C_4 -alkoxy, (C_1 - C_4 -alkylcarbonyl)oxy- C_1 - C_4 -alkyl, hydroxycarbonyl- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, (C_1 - C_4 -alkylsulfonyl)oxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkyl-O-

25

- C(O)-[C₁-C₄-alkyl-O]₃-C₁-C₄-alkyl, carbamoyloxy-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-alkylaminocarbonyl)oxy-C₁-C₄-alkyl, [di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl]oxy-C₁-C₄-alkyl, [(C₁-C₄-haloalkylsulfonyl)aminocarbonyl]oxy-C₁-C₄-alkyl, benzyloxy, where the phenyl ring may be substituted by 1 to 3 radicals from the group consisting of halogen and C₁-C₄-alkyl, amino, C₁-C₄-alkylamino, di(C₁-C₄-alkyl)amino, (C₁-C₄-alkylsulfonyl)-amino, C₁-C₄-(haloalkylsulfonyl)amino, (C₁-C₄-alkylcarbonyl)amino, carbamoylamino, (C₁-C₄-alkylamino)carbonylamino, [di(C₁-C₄-alkyl)amino]carbonylamino, [(C₁-C₄-haloalkylsulfonyl)aminocarbonyl]-amino, phenyl or heterocyclyl, where the phenyl and the heterocyclyl radical of the two last-mentioned substituents may carry one to three radicals from the following group: halogen, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, hydroxycarbonyl and C₁-C₆-alkoxycarbonyl;
- R¹³, R¹⁴, R¹⁵ are hydrogen, halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, nitro, hydroxyl, C₁-C₄-alkylthio or benzyloxy;
- R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ are hydrogen, C₁-C₆-alkyl, tri(C₁-C₆-alkyl)silyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-alkenyl, C₃-C₆-alkynyl, C₃-C₆-haloalkenyl, C₃-C₆-haloalkynyl, formyl, C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₃-C₆-cycloalkylcarbonyl, C₂-C₆-alkenylcarbonyl, C₂-C₆-alkynylcarbonyl, C₁-C₆-alkoxycarbonyl, C₃-C₆-alkenyloxycarbonyl, C₃-C₆-alkynyloxycarbonyl, C₁-C₆-alkylaminocarbonyl, C₃-C₆-alkenylaminocarbonyl, C₃-C₆-alkynylaminocarbonyl, C₁-C₆-alkylsulfonylaminocarbonyl, C₁-C₆-haloalkylsulfonylaminocarbonyl, di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₁-C₆-alkoxy)-N-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-alkenyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)aminocarbonyl, N-(C₃-C₆-alkynyl)-N-(C₁-C₆-alkoxy)aminocarbonyl, di(C₁-C₆-alkyl)aminothiocarbonyl, C₁-C₆-alkylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxyimino-C₁-C₆-alkyl, N-(C₁-C₆-alkylamino)imino-C₁-C₆-alkyl or N-(di-C₁-C₆-alkylamino)imino-C₁-C₆-alkyl,
- where the alkyl, cycloalkyl and alkoxy radicals mentioned may be partially or fully halogenated and/or may carry one to three of the following groups: cyano, hydroxyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, di(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-alkylcarbonyl,

hydroxycarbonyl, C₁-C₄-alkoxycarbonyl, aminocarbonyl, C₁-C₄-alkylaminocarbonyl, di(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl or C₁-C₄-alkylcarbonyloxy;

5 phenyl, phenyl-C₁-C₆-alkyl, phenylcarbonyl, phenylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, phenoxy carbonyl, phenylaminocarbonyl, phenylsulfonylaminocarbonyl, N-(C₁-C₆-alkyl)-N-(phenyl)aminocarbonyl, phenyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl, heterocyclyl, heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, heterocyclylcarbonyl, heterocyclylcarbonyl-C₁-C₆-alkyl, heterocyclylloxycarbonyl, 10 heterocyclylaminocarbonyl, heterocyclylsulfonylaminocarbonyl, N-(C₁-C₆-alkyl)-N-(heterocyclyl)aminocarbonyl or heterocyclyl-C₁-C₆-alkylcarbonyl,

where the phenyl and the heterocyclyl radical of the 17 last-mentioned substituents may be partially or fully halogenated and/or may carry one to three of the following groups: nitro, 15 cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-haloalkoxy

SO₂R²⁰; -C(O)-[C₁-C₄-alkyl-O]₃-C₁-C₄-alkyl; or -C(O)-O-C₁-C₄-alkyl-O-phenyl, where the phenyl radical may optionally 20 be substituted by one to three radicals from the group consisting of halogen and C₁-C₄-alkyl;

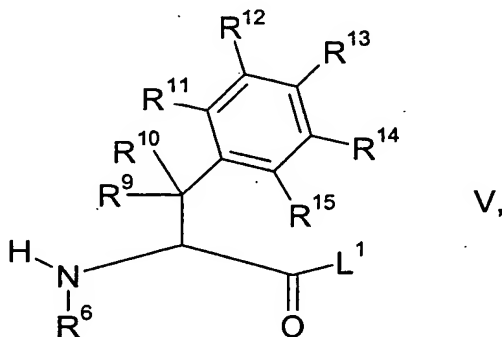
R¹⁹ is hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-alkenyl, C₃-C₆-alkynyl, C₃-C₆-haloalkenyl, C₃-C₆-haloalkynyl, 25 where the alkyl and cycloalkyl radicals mentioned may be partially or fully halogenated and/or may carry one to three of the following groups: cyano, hydroxyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, di(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-alkylcarbonyl, hydroxycarbonyl, C₁-C₄-alkoxycarbonyl, aminocarbonyl, C₁-C₄-alkylaminocarbonyl, di(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl or C₁-C₄-alkylcarbonyloxy; or 30

phenyl, phenyl-C₁-C₆-alkyl, heterocyclyl or heterocyclyl-C₁-C₆-alkyl, where the phenyl and the heterocyclyl radical of the 4 last-mentioned substituents may be partially or fully halogenated, and/or may carry one to three of the following groups: nitro, 35 cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-haloalkoxy;

R^{20} is C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl or phenyl,
 where the phenyl radical may be partially or fully halogenated
 and/or may carry one to three of the following groups: C_1 - C_6 -
 alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl or C_1 - C_6 -alkoxy;

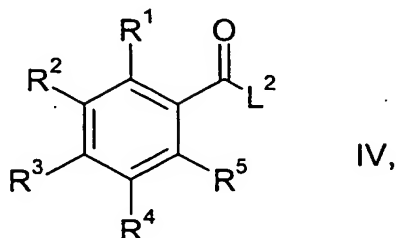
or an agriculturally useful salt thereof.

2. The benzoyl-substituted phenylalanineamide of the formula I according to
 claim 1, where R^1 is halogen or C_1 - C_6 -haloalkyl.
3. The benzoyl-substituted phenylalanineamide of the formula according to claim 1
 or 2, where R^2 and R^3 independently of one another are hydrogen, halogen or
 C_1 - C_6 -haloalkyl.
4. The benzoyl-substituted phenylalanineamide of the formula I according to any
 of claims 1 to 3, where R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{13} , R^{14} and R^{15} are hydrogen.
5. The benzoyl-substituted phenylalanineamide of the formula I according to any
 of claims 1 to 4, where R^9 is OR^{16} .
6. A process for preparing benzoyl-substituted phenylalanineamides of the formula
 I according to claim 1, which comprises
 reacting phenylalanines of the formula V



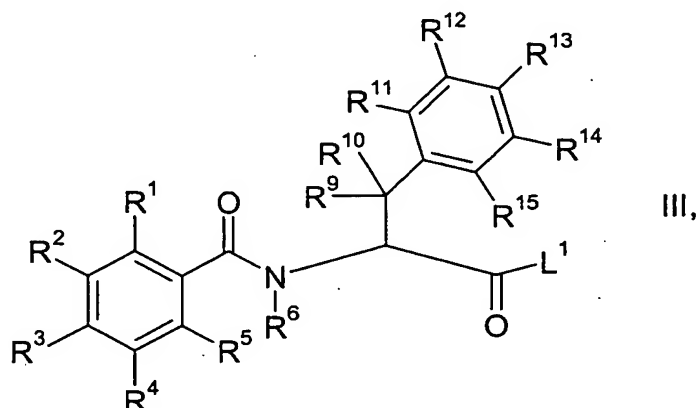
where R^6 and R^9 to R^{15} are as defined in claim 1 and L^1 is a nucleophilically
 displaceable leaving group,

with benzoic acids or benzoic acid derivatives of the formula IV



5 where R^1 to R^5 are as defined in claim 1 and L^2 is a nucleophilically displaceable leaving group

to give the corresponding benzoyl derivatives of the formula III



10

where R^1 to R^6 and R^9 to R^{15} are as defined in claim 1 and L^1 is a nucleophilically displaceable leaving group

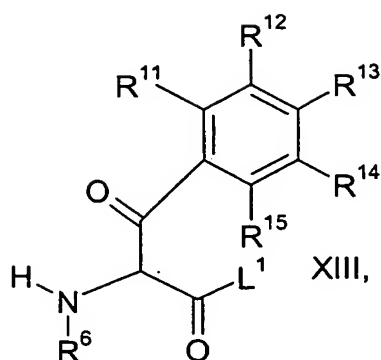
15 and then reacting the resulting benzoyl derivatives of the formula III with an amine of the formula II



20 where R^7 and R^8 are as defined in claim 1.

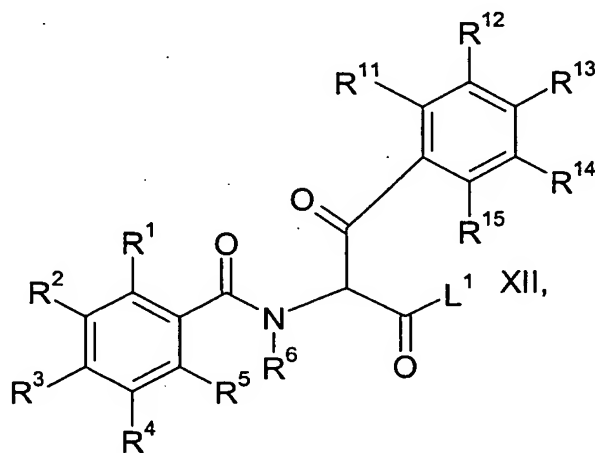
7. The process for preparing benzoyl-substituted phenylalanineamides of the formula I according to claim 1, where R^9 is hydroxyl and R^{10} is hydrogen, which comprises preparing benzoyl derivatives of the formula III where R^9 is hydroxyl and R^{10} is hydrogen by acylation of keto compounds of the formula XIII

25



where R⁶ and R¹¹ to R¹⁵ are as defined in claim 1 and L¹ is a nucleophilically
displaceable leaving group

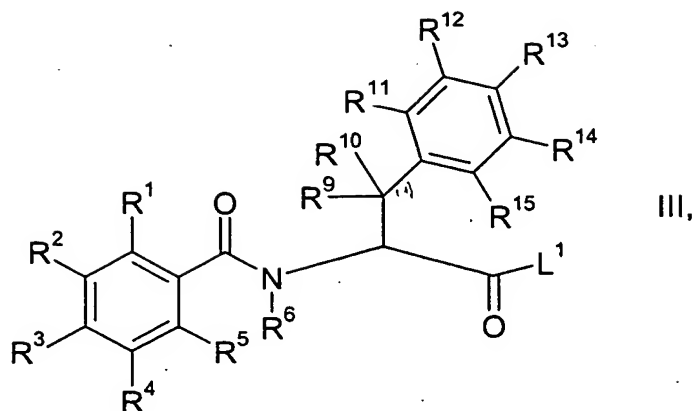
with benzoic acids/benzoic acid derivatives of the formula IV into N-acyl keto
compounds of the formula XII



where R¹ to R⁶ and R¹¹ to R¹⁵ are as defined in claim 1 and L¹ is a
nucleophilically displaceable leaving group, followed by reduction of the keto
group.

8. A benzoyl derivative of the formula III

119



where R^1 to R^6 and R^9 to R^{15} are as defined in claim 1 and L^1 is a nucleophilically displaceable leaving group.

5

9. A composition, comprising a herbicidally effective amount of at least one benzoyl-substituted phenylalanineamide of the formula I or an agriculturally useful salt of I according to any of claims 1 to 5 and auxiliaries customary for formulating crop protection agents.

10

10. A process for preparing compositions according to claim 8, which comprises mixing a herbicidally effective amount of at least one benzoyl-substituted phenylalanineamide of the formula I or an agriculturally useful salt of I according to any of claims 1 to 5 and auxiliaries customary for formulating crop protection agents.

15

11. A method for controlling unwanted vegetation, which comprises allowing a herbicidally effective amount of at least one benzoyl-substituted phenylalanineamide of the formula I or an agriculturally useful salt of I according to any of claims 1 to 5 to act on plants, their habitat and/or on seed.

20

12. The use of a benzoyl-substituted phenylalanineamide of the formula I according to any of claims 1 to 5 or an agriculturally useful salt thereof as a herbicide.